

(19)日本国特許庁 (JP)

## (12) 公表特許公報 (A)

(11)特許出願公表番号

特表平11-500133

(43)公表日 平成11年(1999)1月6日

(51) Int.Cl.  
C 0 7 D 311/60  
A 6 1 K 31/35

識別記号  
AEK

F I  
C 0 7 D 311/60  
A 6 1 K 31/35

AEK

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 62 頁)

(21)出願番号 特願平8-525260  
(86) (22)出願日 平成8年(1996)2月20日  
(85)翻訳文提出日 平成9年(1997)8月21日  
(86)国際出願番号 PCT/CA96/00097  
(87)国際公開番号 WO96/26201  
(87)国際公開日 平成8年(1996)8月29日  
(31)優先権主張番号 08/388,207  
(32)優先日 1995年2月21日  
(33)優先権主張国 米国(US)

(71)出願人 アンドルシェルシュ・インコーポレイテッド  
カナダ、ジイ・1・ダブリュ 2・ジエイ・5 ケベック州、サンーフォワ、ドウ・ラ・プロムナード、2989  
(72)発明者 ラブリー、フェルナンド  
カナダ、ジイ・1・ダブリュ 2・ジエイ・5 ケベック州、サンーフォワ、ドウ・ラ・プロムナード、2989  
(74)代理人 弁理士 深見 久郎 (外3名)

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 ベンゾピラン含有化合物およびその使用方法

## (57)【要約】

乳癌のようなエストロゲン感受性疾患を治療するための特定のベンゾピラン抗エストロゲンが開示される。プロドラッグの形により、製造が容易になり、保存安定性および生物学的利用能が良くなる。好ましい立体異性体はラセミ混合物より有効であることが示される。



## INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification 6 : <b>C07D 311/60, A61K 31/35</b>		A1	(11) International Publication Number: <b>WO 96/26201</b>
			(43) International Publication Date: <b>29 August 1996 (29.08.96)</b>
(21) International Application Number: <b>PCT/CA96/00097</b>		(81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, HU, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, UZ, VN, ARIPO patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), Eurasian patent (AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	
(22) International Filing Date: <b>20 February 1996 (20.02.96)</b>		Published <i>With international search report.</i>	
(30) Priority Data: <b>08/388,207 21 February 1995 (21.02.95) US</b>			
(71) Applicant: ENDORECHERCHE [CA/CA]; 2989 de la Promenade, Sainte-Foy, Quebec G1W 2J5 (CA).			
(72) Inventors: LABRIE, Fernand; 2989 de la Promenade, Sainte-Foy, Quebec G1W 2J5 (CA). MERAND, Yves; 3101 Place Montreux, Sainte-Foy, Quebec G1W 3A1 (CA). GAUTHIER, Sylvain; 1023 Chartier #4, Val-Belair, Quebec G3K 1T2 (CA).			
(74) Agent: MITCHELL, Richard, J.; Marks & Clerk, P.O. Box 957, Station B, Ottawa, Ontario K1P 5S7 (CA).			

## (54) Title: BENZOPYRAN-CONTAINING COMPOUNDS AND METHOD FOR THEIR USE

## (57) Abstract

Certain benzopyran antiestrogens are disclosed for treating estrogen sensitive diseases such as breast cancer. Prodrug forms provide ease of manufacturing, good shelf life, and bioavailability, and preferred stereoisomers are shown to be more effective than racemic mixtures.